

⑫ 公表特許公報(A)

平3-501025

⑬ 公表 平成3年(1991)3月7日

⑭ Int.Cl.⁵
A 61 K 31/557識別記号
ABL
ABV庁内整理番号
7252-4C審査請求 未請求
予備審査請求 未請求

部門(区分) 3(2)

(全 11 頁)

⑮ 発明の名称 緑内障または眼圧亢進の治療のためのプロスタグランジン誘導体

⑯ 特 願 平1-509228
⑰ 出 願 平1(1989)9月6日⑱ 翻訳文提出日 平2(1990)5月2日
⑲ 国際出願 PCT/SE89/00475
⑳ 国際公開番号 WO90/02553
㉑ 国際公開日 平2(1990)3月22日優先権主張 ㉒ 1988年9月6日 ㉓ スウェーデン(SE) ㉔ 8803110-9
㉕ 1988年10月28日 ㉖ スウェーデン(SE) ㉗ 8803855-9

㉘ 発明者 シェルンシヤンツ, ヨハン・ド スウェーデン国エス-752 38 ウブサラ, ヴイツラヴエイエン
ウツベルトヴェー 1ペー

㉙ 発明者 レスル, パーラム スウェーデン国エス-754 49 ウブサラ, ヴイートコールスガタ
ン112

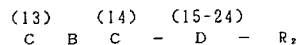
㉚ 出 願 人 ファーマシア・アクチエボラー スウェーデン国エス-751 82 ウブサラ (番地なし)
グ

㉛ 代理人 弁理士 高木 千嘉 外2名

㉜ 指 定 国 AU, DK, FI, JP, NO, US

請 求 の 範 囲

1) オメガ鎖は下記式:



[式中、Cは炭素原子(数はカッコ内に表示)であり、
Bは単結合、二重結合または三重結合であり、
Dは炭素原子1~10個の鎖であるが、場合によりヘ
テロ原子O、SまたはNで中断されていてよく、各炭
素原子上の置換基はH、アルキル基、好ましくは炭素
原子1~5個の低級アルキル基、カルボニル基、また
はヒドロキシル基であり、

R₂はフェニル基のような環構造であり、未置換であ
るか、またはC₁~C₈アルキル基、C₁~C₈アルコキシ基、
トリフルオロメチル基、C₁~C₈脂肪族アシルアミノ基、
ニトロ基、ハロゲン原子、およびフェニル基から選択
される置換基の少なくとも1つを有するもの;または、
環原子5~6個を有する芳香族ヘテロ環基、例えばチ
アゾール、イミダゾール、ピロリジン、チオベンおよ
びオキサゾール;または環内に炭素原子3~7個を有
するシクロアルカンまたはシクロアルケン、ただし、
場合により炭素原子1~5個の低級アルキル基で置換
されているものである]

の構造を有する、プロスタグランジンPGA、PGB、PGD、
PGEまたはPGFの、治療活性があり生理学的に許容され
る誘導体の、緑内障または眼圧亢進の治療のための眼科

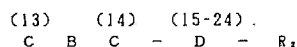
用組成物の調製のための使用。

- 2) 式中、Dが炭素原子2~8個を有する鎖である請求
項1記載の使用。
- 3) 式中、Dが炭素原子2~5個を有する鎖である請求
項1記載の使用。
- 4) 式中、Dが炭素原子3個を有する鎖である請求項1
記載の使用。
- 5) 式中、Bが単結合または二重結合であり、C₁上の
置換基がカルボニル基または(R)-OHまたは(S)-OHであ
る請求項1~4のいずれか1項に記載の使用。
- 6) 式中、R₂がフェニル基ただし未置換であるかまたは
C₁~C₈アルキル基、C₁~C₈アルコキシ基、トリフルオ
ロメチル基、C₁~C₈脂肪族アシルアミノ基、ニトロ基、
ハロゲン原子またはフェニル基から選択される置換基
の少なくとも1つを有するものである請求項1~5の
いずれか1項に記載の使用。
- 7) プロスタグランジン誘導体が17-フェニル-18,19,
20-トリノル類縁体である請求項6記載の使用。
- 8) プロスタグランジン誘導体が15-デヒドロ-17-フ
エニル-18,19,20-トリノル類縁体または13,14-ジ
ヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体で
ある請求項7記載の使用。
- 9) プロスタグランジン誘導体がPGA、PGEまたはPGFの
13,14-ジヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノ
ル誘導体である請求項8記載の使用。

10) プロスタグランジンがPGA、PGEまたはPGFの15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル誘導体である請求項8記載の使用。

11) プロスタグランジン誘導体がアルキルエステルである請求項1~10のいずれか1項に記載の使用。

12) オメガ鎖が下記式:



(式中、Cは炭素原子(数はカッコ内に表示)であり、Bは単結合、二重結合または三重結合であり、

Dは炭素原子1~10個の鎖であるが、場合によりヘテロ原子O、SまたはNで中断されていてよく、各炭素原子上の置換基はH、アルキル基、好ましくは炭素原子1~5個の低級アルキル基、カルボニル基、またはヒドロキシル基であり、

R₂はフェニル基のような環構造であり、未置換であるか、またはC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁~C₂脂肪族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、およびフェニル基から選択される置換基の少なくとも1つを有するもの;または、環原子5~6個を有する芳香族ヘテロ環基、例えばチアゾール、イミダゾール、ピロリジン、チオベンおよびオキサゾール;または環内に炭素原子3~7個を有するシクロアルカンまたはシクロアルケン、ただし、場合により炭素原子1~5個の低級アルキル基で置換

されているものである]

の構造を有する、プロスタグランジンPGA、PGB、PGD、PGEまたはPGFの、治療活性があり生理学的に許容される誘導体の、眼圧低下有効量と眼の表面を接触させることからなる、対象の眼の緑内障または眼圧亢進を治療する方法。

13) 式中、Dが炭素原子2~8個を有する鎖である請求項12記載の方法。

14) 式中、Dが炭素原子2~5個を有する鎖である請求項12記載の方法。

15) 式中、Dが炭素原子3個を有する鎖である請求項12記載の方法。

16) 式中、Bが単結合または二重結合であり、C₁上の置換基がカルボニル基または(R)-OHまたは(S)-OHである請求項12~15のいずれか1項に記載の方法。

17) 式中、R₂がフェニル基、ただし未置換であるかまたはC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁~C₂脂肪族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子またはフェニル基から選択される置換基の少なくとも1つを有するものである請求項12~16のいずれか1項に記載の方法。

18) プロスタグランジン誘導体が17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体である請求項17記載の方法。

19) プロスタグランジン誘導体が15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体または13,14-ジ

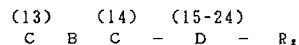
ヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体である請求項18記載の方法。

20) プロスタグランジン誘導体がPGA、PGEまたはPGFの15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル誘導体である請求項19記載の方法。

21) プロスタグランジンがPGA、PGEまたはPGFの13,14-ジヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル誘導体である請求項20記載の方法。

22) プロスタグランジン誘導体がアルキルエステルである請求項12~21のいずれか1項に記載の方法。

23) オメガ鎖が下記式:



(式中、Cは炭素原子(数はカッコ内に表示)であり、Bは単結合、二重結合または三重結合であり、

Dは炭素原子1~10個の鎖であるが、場合によりヘテロ原子O、SまたはNで中断されていてよく、各炭素原子上の置換基はH、アルキル基、好ましくは炭素原子1~5個の低級アルキル基、カルボニル基、またはヒドロキシル基であり、

R₂はフェニル基のような環構造であり、未置換であるか、またはC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁~C₂脂肪族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、およびフェニル基から選択される置換基の少なくとも1つを有するもの;または、

環原子5~6個を有する芳香族ヘテロ環基、例えばチアゾール、イミダゾール、ピロリジン、チオベンおよびオキサゾール;または環内に炭素原子3~7個を有するシクロアルカンまたはシクロアルケン、ただし、場合により炭素原子1~5個の低級アルキル基で置換されているものである]

の構造を有する、プロスタグランジンPGA、PGB、PGD、PGEまたはPGFの、治療活性があり生理学的に許容される誘導体の、眼圧低下有効量を眼科用に適する担体中に含有する緑内障または眼圧亢進の局所治療のための眼科用組成物。